


PCT WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
 Internationales Büro
 INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
 INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

<p>(51) Internationale Patentklassifikation ⁶ : A01N 51/00, 61/00 // (A01N 51/00, 25:02) (A01N 61/00, 25:02)</p>	A1	<p>(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 96/17520</p> <p>(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 13. Juni 1996 (13.06.96)</p>
<p>(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP95/04667</p> <p>(22) Internationales Anmeldedatum: 27. November 1995 (27.11.95)</p> <p>(30) Prioritätsdaten: P 44 43 888.5 9. December 1994 (09.12.94) DE</p> <p>(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen (DE).</p> <p>(72) Erfinder; und (73) Erfinder/Anmelder (nur für US): SIRINYAN, Kirkor [TR/DE]; Humperdinckstrasse 12, D-51467 Bergisch Gladbach (DE). DORN, Hubert [DE/DE]; Pahlkestrasse 71, D-42115 Wuppertal (DE). KUJANEK, Richard [DE/DE]; Wolfskaul 3, D-51061 Köln (DE). KRIEGER, Klemens [DE/DE]; Loxsteeg 1, D-51789 Lindlar (DE). HEUKAMP, Ulrich [DE/DE]; Am Damberg 2, D-51515 Kürten (DE). HACKEMÜLLER, Doris [DE/DE]; Norfer Strasse 19, D-40221 Düsseldorf (DE). HOPKINS, Terence [AU/AU]; 41 Boomerang Road, Taborine, QLD 4270 (AU).</p> <p>(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; D-51368 Leverkusen (DE).</p>	<p>(81) Bestimmungsstaaten: AU, BB, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, FI, HU, JP, KR, KZ, LK, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SK, UA, US, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).</p> <p>Veröffentlicht <i>Mit internationalem Recherchenbericht. Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist. Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.</i></p>	
<p>(54) Title: PARASITICIDAL FORMULATIONS THAT CAN BE APPLIED DERMALLY</p> <p>(54) Bezeichnung: DERMAL APPLIZIERBARE FORMULIERUNGEN VON PARASITIZIDEN</p> <p>(57) Abstract</p> <p>The invention pertains to formulations applied dermally to combat parasitic insects on animals, having the following composition: agonists or antagonists of the nicotinergous acetylcholine receptors of insects in a concentration of 1 to 20 wt.% relative to the total weight of the formulation; solvent from the benzyl alcohol group or optionally pyrrolidones in a concentration of at least 20 wt.% relative to the total weight of the formulation; optionally other solvents from the group of cyclic carbonates or lactones in a concentration of 5.0 to 80 wt.% relative to the total weight of the formulation; optionally other adjuvants from the group of thickeners, spreaders, dyes, antioxidant agents, blowing agents, preservatives, adhesives, emulsifiers in a concentration of 0.025 to 10 wt.% relative to the total weight of the formulation.</p> <p>(57) Zusammenfassung</p> <p>Die vorliegende Erfindung betrifft Formulierungen zur dermalen Bekämpfung von parasitierenden Insekten an Tieren folgender Zusammensetzung: Agonisten oder Antagonisten der nicotinergen Acetylcholinrezeptoren von Insekten in einer Konzentration von 1 bis 20 Gew.-% bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung; Lösungsmittel aus der Gruppe Benzylalkohol oder gegebenenfalls substituierte Pyrrolidone in einer Konzentration von mindestens 20 Gew.-% bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung; gegebenenfalls weitere Lösungsmittel aus der Gruppe cyclischer Carbonate oder Lactone in einer Konzentration von 5,0 bis zu 80 Gew.-% bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung; gegebenenfalls weitere Hilfsmittel aus der Gruppe Verdickungsmittel, Spreitmittel, Farbstoffe, Antioxidantien, Treibmittel, Konservierungsstoffe, Haftmittel, Emulgatoren, in einer Konzentration von 0,025 bis zu 10 Gew.-% bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung.</p>		

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AT	Österreich	GA	Gabon	MR	Mauretanien
AU	Australien	GB	Vereinigtes Königreich	MW	Malawi
BB	Barbados	GE	Georgien	NE	Niger
BE	Belgien	GN	Guinea	NL	Niederlande
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	NO	Norwegen
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	NZ	Neuseeland
BJ	Benin	IE	Irland	PL	Polen
BR	Brasilien	IT	Italien	PT	Portugal
BY	Belarus	JP	Japan	RO	Rumänien
CA	Kanada	KE	Kenya	RU	Russische Föderation
CF	Zentrale Afrikanische Republik	KG	Kirgisistan	SD	Sudan
CG	Kongo	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	SE	Schweden
CH	Schweiz	KR	Republik Korea	SI	Slowenien
CI	Côte d'Ivoire	KZ	Kasachstan	SK	Slowakei
CM	Kamerun	LI	Liechtenstein	SN	Senegal
CN	China	LK	Sri Lanka	TD	Tschad
CS	Tschechoslowakei	LU	Luxemburg	TG	Togo
CZ	Tschechische Republik	LV	Lettland	TJ	Tadschikistan
DE	Deutschland	MC	Monaco	TT	Trinidad und Tobago
DK	Dänemark	MD	Republik Moldau	UA	Ukraine
ES	Spanien	MG	Madagaskar	US	Vereinigte Staaten von Amerika
FI	Finnland	ML	Mali	UZ	Usbekistan
FR	Frankreich	MN	Mongolei	VN	Vietnam

Dermal applizierbare Formulierungen von Parasitiziden

Die vorliegende Erfindung betrifft Formulierungen zur dermalen Bekämpfung von parasitierenden Insekten an Tieren mittels Agonisten oder Antagonisten der nicotineren Acetylcholinrezeptoren von Insekten.

- 5 Agonisten oder Antagonisten der nicotineren Acetylcholinrezeptoren von Insekten sind bekannt. Zu ihnen gehören die Nicotiny-Insektizide und ganz besonders die Chlornicotiny-Insektizide.

- 10 Aus der PCT-Anmeldung WO 93/24 002 ist bekannt, daß sich bestimmte 1-[N-(Halo-3-pyridylmethyl)]-N-methylamino-1-alkylamino-2-nitroethylen-Derivate zur systemischen Anwendung gegen Flöhe bei Haustieren eignen. Als ungeeignet zur Bekämpfung der Flöhe an Haustieren wird nach WO 93/24 002 die nicht-systemische d.h. dermale Art der Anwendung dargestellt.

- 15 Es wurden nun neue Formulierungen zur dermalen Anwendung von Agonisten oder Antagonisten der nicotineren Acetylcholinrezeptoren von Insekten gefunden, die sich besonders zur dermalen Bekämpfung parasitierender Insekten wie Flöhen, Läusen oder Fliegen an Tieren eignen.

Die erfindungsgemäßen Formulierungen haben folgende Zusammensetzung:

- 20 - Agonisten oder Antagonisten der nicotineren Acetylcholinrezeptoren von Insekten in einer Konzentration von 1 bis 20 Gew.-% bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung;
- Lösungsmittel aus der Gruppe Benzylalkohol oder gegebenenfalls substituierte Pyrrolidone in einer Konzentration von mindestens 20 Gew.-% bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung;

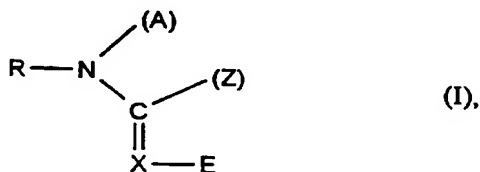
- 2 -

- gegebenenfalls weitere Lösungsmittel aus der Gruppe cyclischer Carbonate oder Lactone in einer Konzentration von 5,0 bis zu 80 Gew.-% bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung;
- 5 - gegebenenfalls weitere Hilfsmittel aus der Gruppe Verdickungsmittel, Spreitmittel, Farbstoffe, Antioxidantien, Treibmittel, Konservierungsstoffe, Haftmittel, Emulgatoren, in einer Konzentration von 0,025 bis zu 10 Gew.-% bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung.

Agonisten oder Antagonisten der nicotinogen Acetylcholinrezeptoren von Insekten sind bekannt z.B. aus Europäische Offenlegungsschriften Nr. 464 830, 428 941, 10 425 978, 386 565, 383 091, 375 907, 364 844, 315 826, 259 738, 254 859, 235 725, 212 600, 192 060, 163 855, 154 178, 136 636, 303 570, 302 833, 306 696, 189 972, 455 000, 135 956, 471 372, 302 389; Deutsche Offenlegungsschriften Nr. 3 639 877, 3 712 307; Japanische Offenlegungsschriften Nr. 03 220 176, 02 207 083, 63 307 857, 63 287 764, 03 246 283, 04 9371, 15 03 279 359, 03 255 072; US-Patentschriften Nr. 5 034 524, 4 948 798, 4 918 086, 5 039 686, 5 034 404; PCT-Anmeldungen Nr. WO 91/17 659, 91/4965; Französische Anmeldung Nr. 2 611 114; Brasilianische Anmeldung Nr. 88 03 621.

Auf die in diesen Publikationen beschriebenen Verbindungen und ihre Herstellung wird hiermit ausdrücklich Bezug genommen.

- 20 Diese Verbindungen lassen sich bevorzugt durch die allgemeine Formel (I) wiedergeben



in welcher

- 25 R für Wasserstoff, gegebenenfalls substituierte Reste der Gruppe Acyl, Alkyl, Aryl, Aralkyl, Heteroaryl oder Heteroarylalkyl steht;

- 3 -

- A für eine monofunktionelle Gruppe aus der Reihe Wasserstoff, Acyl, Alkyl, Aryl steht oder für eine bifunktionelle Gruppe steht, die mit dem Rest Z verknüpft ist;
- E für einen elektronenziehenden Rest steht;
- 5 X für die Reste -CH= oder =N- steht, wobei der Rest -CH= anstelle eines H-Atoms mit dem Rest Z verknüpft sein kann;
- Z für eine monofunktionelle Gruppe aus der Reihe Alkyl, -O-R, -S-R,
- $$\begin{array}{c} \text{R} \\ \diagup \\ \text{---N} \\ \diagdown \\ \text{R} \end{array} \text{ steht}$$
- oder für eine bifunktionelle Gruppe steht, die mit dem Rest A oder dem Rest X verknüpft ist.
- 10

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), in welcher die Reste folgende Bedeutung haben:

- R steht für Wasserstoff sowie für gegebenenfalls substituierte Reste aus der Reihe Acyl, Alkyl, Aryl, Aralkyl, Heteroaryl, Heteroarylalkyl.
- 15 Als Acylreste seien genannt Formyl, Alkylcarbonyl, Arylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Arylsulfonyl, (Alkyl-)-(Aryl-)-phosphoryl, die ihrerseits substituiert sein können.
- Als Alkyl seien genannt C₁₋₁₀-Alkyl, insbesondere C₁₋₄-Alkyl, im einzelnen Methyl, Ethyl, i-Propyl, sec.- oder t.-Butyl, die ihrerseits substituiert sein können.
- 20 Als Aryl seien genannt Phenyl, Naphthyl, insbesondere Phenyl.
- Als Aralkyl seien genannt Phenylmethyl, Phenethyl.

Als Heteroaryl seien genannt Heteroaryl mit bis zu 10 Ringatomen und N, O, S insbesondere N als Heteroatomen. Im einzelnen seien genannt Thienyl, Furyl, Thiazolyl, Imidazolyl, Pyridyl, Benzthiazolyl.

5 Als Heteroarylalkyl seien genannt Heteroarylmethyl, Heteroarylethyl mit bis zu 6 Ringatomen und N, O, S, insbesondere N als Heteroatomen.

Als Substituenten seien beispielhaft und vorzugsweise aufgeführt:
Alkyl mit vorzugsweise 1 bis 4, insbesondere 1 oder 2 Kohlenstoffatomen, wie Methyl, Ethyl, n- und i-Propyl und n-, i- und t-Butyl; Alkoxy mit vorzugsweise 1 bis 4, insbesondere 1 oder 2 Kohlenstoffatomen, wie Methoxy, 10 Ethoxy, n- und i-Propyloxy und n-, i- und t-Butyloxy; Alkylthio mit vorzugsweise 1 bis 4, insbesondere 1 oder 2 Kohlenstoffatomen, wie Methylthio, Ethylthio, n- und i-Propylthio und n-, i- und t-Butylthio; Halogenalkyl mit vorzugsweise 1 bis 4, insbesondere 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 15 vorzugsweise 1 bis 5, insbesondere 1 bis 3 Halogenatomen, wobei die Halogenatome gleich oder verschieden sind und als Halogenatome, vorzugsweise Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere Fluor stehen, wie Trifluormethyl; Hydroxy; Halogen, vorzugsweise Fluor, Chlor, Brom und Jod, insbesondere Fluor, Chlor und Brom; Cyano; Nitro; Amino; Monoalkyl- und Dialkylamino mit vorzugsweise 1 bis 4, insbesondere 1 oder 2 Kohlenstoffatomen je Alkylgruppe, wie Methylamino, Methyl-ethyl-amino, n- und 20 i-Propylamino und Methyl-n-butylamino; Carboxyl; Carbalkoxy mit vorzugsweise 2 bis 4, insbesondere 2 oder 3 Kohlenstoffatomen, wie Carbo-methoxy und Carboethoxy; Sulfo ($-SO_3H$); Alkylsulfonyl mit vorzugsweise 1 bis 4, insbesondere 1 oder 2 Kohlenstoffatomen, wie Methylsulfonyl und 25 Ethylsulfonyl; Arylsulfonyl mit vorzugsweise 6 oder 10 Arylkohlenstoffatomen, wie Phenylsulfonyl sowie Heteroarylamino und Heteroarylalkyl-amino wie Chlorpyridylamino und Chlorpyridylmethy-lamino.

A steht besonders bevorzugt für Wasserstoff sowie für gegebenenfalls substituier-te Reste aus der Reihe Acyl, Alkyl, Aryl, die bevorzugt die bei R angegebenen Bedeutungen haben. A steht ferner für eine bifunktionelle 30 Gruppe. Genannt sei gegebenenfalls substituiertes Alkylen mit 1-4, insbesondere 1-2 C-Atomen, wobei als Substituenten die weiter oben aufgezähl-

ten Substituenten genannt seien und wobei die Alkylengruppen durch Heteroatome aus der Reihe N, O, S unterbrochen sein können.

- 5 A und Z können gemeinsam mit den Atomen, an welche sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten heterocyclischen Ring bilden. Der heterocyclische Ring kann weitere 1 oder 2 gleiche oder verschiedene Heteroatome und/oder Heterogruppen enthalten. Als Heteroatome stehen vorzugsweise Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff und als Heterogruppen N-Alkyl, wobei Alkyl der N-Alkyl-Gruppe vorzugsweise 1 bis 4, insbesondere 1 oder 2 Kohlenstoffatome enthält. Als Alkyl seien Methyl, Ethyl, n- und i-Propyl und n-, i- und t-Butyl genannt. Der heterocyclische Ring enthält 10 bis 7, vorzugsweise 5 oder 6 Ringglieder.

Als Beispiele für den heterocyclischen Ring seien Pyrrolidin, Piperidin, Piperazin, Hexamethylenimin, Hexahydro-1,3,5-triazin, Morpholin genannt, die gegebenenfalls bevorzugt durch Methyl substituiert sein können.

- 15 E steht für einen elektronenziehenden Rest, wobei insbesondere NO₂, CN, Halogenalkylcarbonyl wie 1,5-Halogen-C₁₋₄-carbonyl, insbesondere COCF₃ genannt seien.

X steht für -CH= oder -N=

- 20 Z steht für gegebenenfalls substituierte Reste Alkyl, -OR, -SR, -NRR, wobei R und die Substituenten bevorzugt die oben angegebene Bedeutung haben.

Z kann außer dem obengenannten Ring gemeinsam mit dem Atom, an

welches es gebunden ist und dem Rest $\begin{array}{c} | \\ =\text{C}- \end{array}$

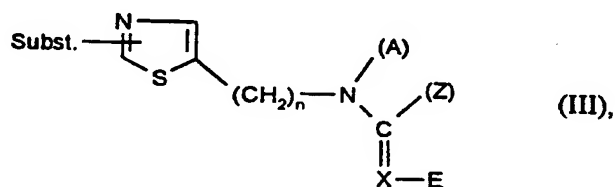
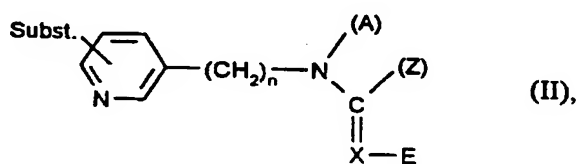
- 25 an der Stelle von X einen gesättigten oder ungesättigten heterocyclischen Ring bilden. Der heterocyclische Ring kann weitere 1 oder 2 gleiche oder verschiedene Heteroatome und/oder Heterogruppen enthalten. Als Heteroatome stehen vorzugsweise Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff und als Heterogruppen N-Alkyl, wobei die Alkyl oder N-Alkyl-Gruppe vorzugsweise 1 bis 4, insbesondere 1 oder 2 Kohlenstoffatome enthält. Als Alkyl

- 6 -

seien Methyl, Ethyl, n- und i-Propyl und n-, i- und t-Butyl genannt. Der heterocyclische Ring enthält 5 bis 7, vorzugsweise 5 oder 6 Ringglieder.

Als Beispiele für den heterocyclischen Ring seien Pyrrolidin, Piperidin, Piperazin, Hexamethylenimin, Morphin und N-Methylpiperazin genannt.

- 5 Als ganz besonders bevorzugt erfindungsgemäß verwendbare Verbindungen seien Verbindungen der allgemeinen Formeln (II) und (III) genannt:



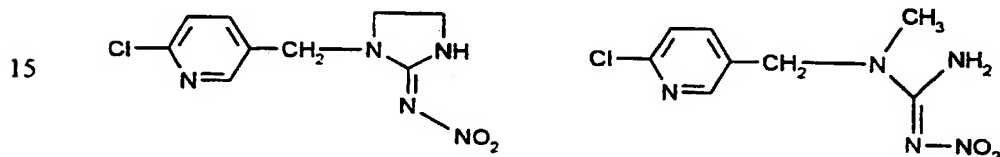
in welchen

- 10 n für 1 oder 2 steht,

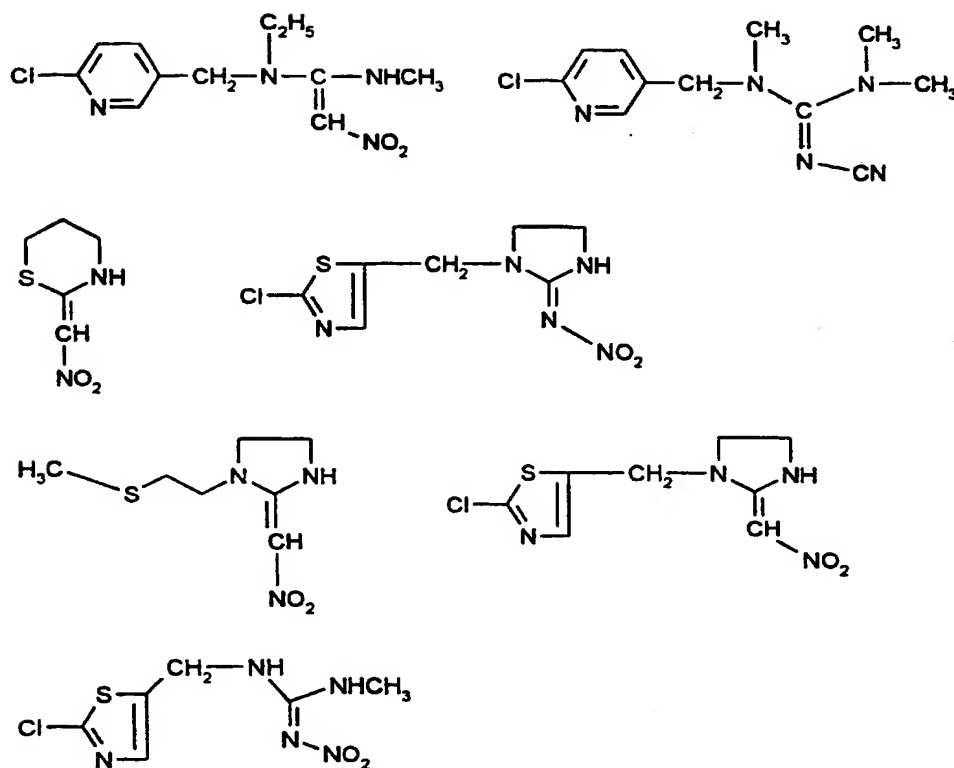
Subst. für einen der oben aufgeführten Substituenten, insbesondere für Halogen, ganz besonders für Chlor, steht,

A, Z, X und E die oben angegebenen Bedeutungen haben,

Im einzelnen seien folgende Verbindungen genannt:



- 8 -



- 5 Die erfindungsgemäßen Formulierungen enthalten den Wirkstoff in Konzentrationen von 0,1 bis 20 Gew.-%, bevorzugt von 1 bis 12,5 Gew.-%.

Zubereitungen die vor Anwendung verdünnt werden, enthalten den Wirkstoff in Konzentrationen von 0,5 bis 90 Gew.-%, bevorzugt von 1 bis 50 Gew.-%.

- 10 Im allgemeinen hat es sich als vorteilhaft erwiesen, Mengen von etwa 0,5 bis etwa 50 mg, bevorzugt 1 bis 20 mg, Wirkstoff je Körpergewicht pro Tag zur Erzielung wirksamer Ergebnisse zu verabreichen.

Als Lösungsmittel kommen in Frage:

- 15 Benzylalkohol oder gegebenenfalls substituierte Pyrrolidone wie Pyrrolidon-2, 1-(C₂₋₂₀-Alkyl)-pyrrolidon-2, insbesondere 1-Ethylpyrrolidon, 1-Octylpyrrolidon, 1-Dodecylpyrrolidon, 1-Isopropylpyrrolidon, 1-(s. oder t. oder n-Butyl)-pyrrolidon, 1-Hexylpyrrolidon, 1-(C₂₋₁₀-Alkenyl)-pyrrolidon-2 wie 1-Vinylpyrrolidon-2, 1-(C₃₋₈-Cycloalkyl)-pyrrolidon-2 wie 1-Cyclohexylpyrrolidon, 1-(C₁₋₆-Hydroxy-

alkyl)-pyrrolidon-2, 1-(C₁₋₆-Alkoxy-C₁₋₆-alkyl)-pyrrolidon-2 wie 1-(2-Hydroxyethyl)-pyrrolidon, 1-(3-Hydroxypropyl)-pyrrolidon, 1-(2-Methoxyethyl)-pyrrolidon, 1-(3-Methoxypropyl)-pyrrolidon, ferner 1-Benzylpyrrolidon. Besonders genannt seien Benzylalkohol oder n-Dodecyl- oder n-Octylpyrrolidon. Diese Lösungsmittel
5 können entweder allein oder in Mischung mit weiteren Lösungsmitteln (Colösungsmitteln) eingesetzt werden.

Sie liegen vor in einer Konzentration von mindestens 20 Gew.-%, bevorzugt 40 bis 90 Gew.-%, besonders bevorzugt 50 bis 90 Gew.-%.

10 Als weitere Lösungsmittel oder Colösungsmittel kommen in Frage: cyclische Carbonate oder Lactone. Als solche seien genannt: Ethylencarbonat, Propylencarbonat, γ -Butyrolacton.

Sie liegen vor in einer Konzentration von 5,0 bis zu 80 Gew.-%, bevorzugt von 7,5 bis 50 Gew.-%, besonders bevorzugt von 10 bis 50 Gew.-%.

15 Als weitere Hilfsmittel kommen in Frage: Konservierungsmittel wie Benzylalkohol (nicht erforderlich falls bereits als Lösungsmittel vorhanden), Trichlorbutanol, p-Hydroxybenzoesäureester, n-Butanol.

20 Verdickungsmittel wie: Anorganische Verdickungsmittel wie Bentonite, kolloidale Kieselsäure, Aluminiummonostearat, organische Verdickungsmittel wie Cellulosederivate, Polyvinylalkohole, Polyvinylpyrrolidone und deren Copolymere, Acrylate und Methacrylate.

Als Farbstoffe seien genannt alle zur Anwendung am Tier zugelassenen Farbstoffe, die gelöst oder suspendiert sein können.

25 Hilfsstoffe sind auch spreitende Öle wie Adipinsäure-di-2-ethylhexylester, Isopropylmyristat, Dipropylenglykolpelargonat, cyclische und acyclische Silikonöle wie Dimetikone und ferner deren Co- und Terpolymerisate mit Ethylenoxid, Propylenoxid und Formalin, Fettsäureester, Triglyceride, Fettalkohole.

Antioxidantien sind Sulfite oder Metabisulfite wie Kaliummetabisulfit, Ascorbinsäure, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Tocopherol.

Lichtschutzmittel sind z.B. Stoffe aus der Klasse der Benzophenone oder Novantisolsäure.

Haftmittel sind z.B. Cellulosederivate, Stärkederivate, Polyacrylate, natürliche Polymere wie Alginate, Gelatine.

- 5 Hilfsstoffe sind auch Emulgatoren wie nichtionogene Tenside, z.B. polyoxyethyliertes Rizinusöl, polyoxyethyliertes Sorbitan-monooleat, Sorbitan-monostearat, Glycerinmonostearat, Polyoxyethylstearat, Alkylphenolpolyglykol-ether;

ampholytische Tenside wie Di-Na-N-lauryl- β -iminodipropionat oder Lecithin;

- 10 anionaktive Tenside, wie Na-Laurylsulfat, Fettalkoholethersulfate, Mono/Dialkylpolyglykoletherorthophosphor-säureester-monoethanolaminsalz;
kationaktive Tenside wie Cetyltrimethylammoniumchlorid.

- 15 Weitere Hilfsstoffe sind Mittel mit denen die erfindungsgemäßen Formulierungen auf die Haut gesprüht oder gespritzt werden können. Dabei handelt es sich um die für Spraydosen benötigten üblichen Treibgase wie Propan, Butan, Dimethylether, CO₂ oder halogenierte Niedrigalkane, bzw. deren Mischungen untereinander.

- 20 Die erfindungsgemäßen Formulierungen eignen sich bei günstiger Warmblütertoxizität zur Bekämpfung von parasitierenden Insekten, die in der Tierhaltung und Tierzucht bei Haus- und Nutztieren sowie Zoo-, Labor-, Versuchs- und Hobbytieren vorkommen. Sie sind dabei gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien der Schädlinge sowie gegen resistente und normal sensible Arten der Schädlinge wirksam.

Zu den Schädlingen gehören:

- 25 Aus der Ordnung der Anoplura z.B. Haematopinus spp., Linognathus spp., Solenopotes spp., Pediculus spp., Pthirus spp.;
aus der Ordnung der Mallophaga z.B. Trimenopon spp., Menopon spp., Eomenacanthus spp., Menacanthus spp., Trichodectes spp., Felicola spp., Damalinae spp., Bovicola spp;

aus der Ordnung der Diptera z.B. Chrysops spp., Tabanus spp., Musca spp.,
Hydrotaea spp., Muscina spp., Haematobosca spp., Haematobia spp., Stomoxys
spp., Fannia spp., Glossina spp., Lucilia spp., Calliphora spp., Auchmeromyia spp.,
Cordylobia spp., Cochliomyia spp., Chrysomyia spp., Sarcophaga spp., Wohlfartia
5 spp., Gasterophilus spp., Oesteromyia spp., Oedemagena spp., Hypoderma spp.,
Oestrus spp., Rhinoestrus spp., Melophagus spp., Hippobosca spp..

Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Ctenocephalides spp., Echidnophaga spp.,
Ceratophyllus spp..

10 Besonders hervorgehoben sei die Wirkung gegen Siphonaptera, insbesondere
gegen Flöhe.

Zu den Nutz- und Zuchttieren gehören Säugetiere wie z.B. Rinder, Pferde, Schafe,
Schweine, Ziegen, Kamele, Wasserbüffel, Esel, Kaninchen, Damwild, Rentiere,
Pelztiere wie z.B. Nerze, Chinchilla, Waschbär, Vögel wie z.B. Hühner, Gänse,
Puten, Enten.

15 Zu Labor- und Versuchstieren gehören Mäuse, Ratten, Meerschweinchen,
Goldhamster, Hunde und Katzen.

Zu den Hobbytieren gehören Hunde und Katzen.

Die Anwendung kann sowohl prophylaktisch als auch therapeutisch erfolgen.

20 In den erfindungsgemäßen Formkörpern können auch weitere Wirkstoffe enthalten
sein. Zu den weiteren Wirkstoffen gehören Insektizide wie phosphorhaltige Ver-
bindungen, d.h. Phosphor- oder Phosphorsäureester, natürliche oder synthetische
Pyrethroide, Carbamate, Amidine, Juvenilhormone und juvenoide synthetische
Wirkstoffe, sowie Chiünsynthesehemmer wie Diarylether und Benzoylhamstoffe.

Zu den Phosphor- oder Phosphorsäureestern gehören:

25 0-Ethyl-0-(8-chinolyl)phenyl-thiophosphat (Quintiofos),

0,0-Diethyl-0-(3-chloro-4-methyl-7-coumarinyl)-thiophosphat (Coumaphos),

0,0-Diethyl-0-phenylglyoxylonitril-oxim-thiophosphat (Phoxim),

0,0-Diethyl-0-cyanochlorbenzaldoxim-thiophosphat (Chlorphoxim),

0,0-Diethyl-0-(4-bromo-2,5-dichlorophenyl)-phosphorothionat (Bromophos-ethyl),

0,0,0',0'-Tetraethyl-S,S'-methylene-di(phosphorodithionat) (Ethion),

5 2,3-p-Dioxanedithiol-S,S-bis(0,0-diethylphosphorodithionat,

2-Chlor-1-(2,4-dichlorophenyl)-vinyl-diethylphosphat (Chlorfenvinphos),

0,0-Dimethyl-0-(3-methyl-4-methylthiophenyl)-thionophosphorsäureester
(Fenthion).

Zu den Carbamaten gehören:

10 2-Isopropoxyphenylmethylcarbammat (Propoxur),

1-Naphthyl-N-methylcarbammat (Carbaryl).

Zu den synthetischen Pyrethroiden zählen

3-[2-(4-Chlorphenyl)-2-chlorvinyl]-2,2-dimethyl-cyclo-propancarbonsäure
[(α -cyano-4-fluor-3-phenoxy)-benzyl]-ester (Flumethrin),

15 2,2-Dimethyl-3-(2,2-dichlorvinyl)-cyclopropancarbonsäure- α -cyano(4-fluor-3-
phenoxy)-benzyl-ester (Cyfluthrin) und seine Enantiomere und Stereomere,

α -Cyano-3-phenoxybenzyl(+)-cis, trans-3-(2,2-dibromvinyl)-2,2-dimethylcyclo-
propancarboxylat (Deltamethrin),

20 2,2-Dimethyl-3-(2,2-dichlorvinyl)-cyclopropancarbonsäure- α -cyano-3-phenoxy-
benzylester (Cypermethrin),

3-Phenoxybenzyl(±)-cis, trans-3-(2,2-dichlorvinyl)-2,2-dimethylcyclopropan-carboxylat (Permethrin),

α-(p-Cl-phenyl)-isovaleriansäure-α-cyano-3-phenoxy-benzylester (Fenvalerate),

5 2-Cyano-3-phenoxybenzyl-2-(2-chlor-α,α,α-trifluor-p-toluidino)-3-methylbutyrat (Fluvalinate).

Zu den Amidinen gehören:

3-Methyl-2-[2,4-dimethyl-phenylimino]-thiazolin,

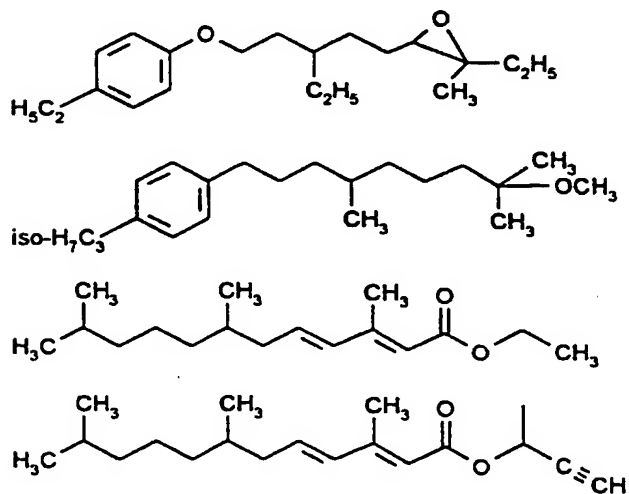
2-(4-Chlor-2-methylphenylimino)-3-methylthiazolidin,

2-(4-Chlor-2-methylphenylimino)-3-(isobutyl-1-enyl)-thiazolidin

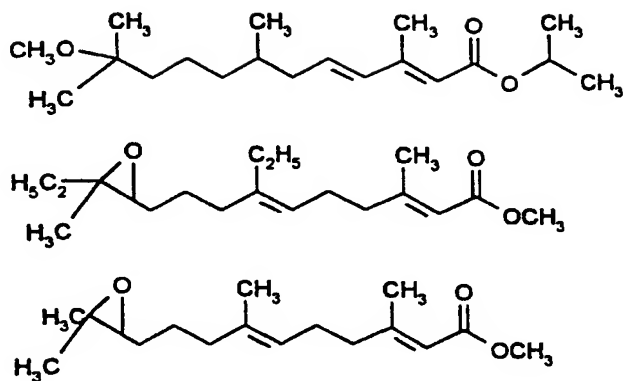
10 1,5-Bis-(2,4-dimethylphenyl)-3-methyl-1,3,5-triazapenta-1,4-dien (Amitraz).

Cyclische Makrolithe wie Ivermectine und Abamectine. Hierzu sei beispielsweise 5-0-Dimethyl-22,23-dihydroavermectin-A_{1a}, -22,23-dihydroavermectin B_{1a} und 22,23-dihydroavermectin B_{b1} (vgl. beispielsweise WHO. F.A. Series 27, S. 27-73 (1991)) erwähnt. Zu den Juvenilhormonen und juvenilhormonartigen Substanzen

15 gehören insbesondere Verbindungen der folgenden Formeln:

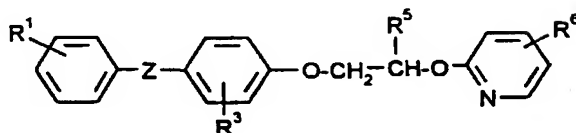


- 14 -



Zu den substituierten Diarylethern gehören insbesondere

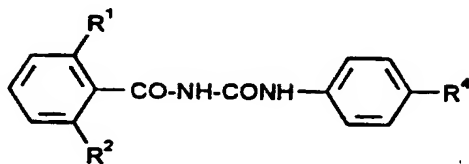
5



10

R^1	R^3	R^5	R^6	Z
H	H	CH ₃	H	O
H	H	CH ₃	2-Cl	O
S-F	H	CH ₃	H	O
H	H	CF ₃	H	O
H	H	C ₂ H ₅	H	O
H	H	H	H	O
H	H	CH ₃	H	CH ₂
H	H	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂

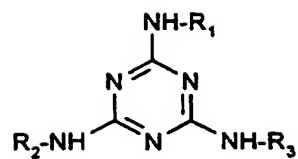
Zu den Benzoylharnstoffen gehören Verbindungen der Formel



R¹	R²	R⁴
H	Cl	CF₃
Cl	Cl	CF₃
F	F	CF₃
H	F	CF₃
H	Cl	SCF₃
F	F	SCF₃
H	F	SCF₃
H	Cl	OCF₃
F	F	OCF₃
H	F	OCF₃
F	F	
F	F	
F	F	

Zu den Triazinen gehören Verbindungen der Formel

- 16 -



5

10

R ₁	R ₂	R ₃
Cyclopropyl	H	H
Cyclopropyl	H	CH ₃
Cyclopropyl	H	C ₂ H ₅
Cyclopropyl	H	C ₃ H _{7-n}
Cyclopropyl	H	C ₄ H _{9-n}
Cyclopropyl	H	C ₅ H _{11-n}
Cyclopropyl	H	C ₆ H _{13-n}
Cyclopropyl	H	C ₇ H _{15-n}

(Fortsetzung)

	R ₁	R ₂	R ₃
	Cyclopropyl	H	C ₈ H _{17-n}
	Cyclopropyl	H	C ₁₂ -H _{25-n}
5	Cyclopropyl	H	CH ₂ -C ₄ H _{9-n}
	Cyclopropyl	H	CH ₂ CH(CH ₃)C ₂ H ₅
	Cyclopropyl	H	CH ₂ CH=CH ₂
	Cyclopropyl	Cl	C ₂ H ₅
	Cyclopropyl	Cl	C ₆ H _{13-n}
10	Cyclopropyl	Cl	C ₈ H _{17-n}
	Cyclopropyl	Cl	C ₁₂ H _{25-n}
	Cyclopropyl	H	Cyclopropyl
	Cyclopropyl	H	COCH ₃
	Cyclopropyl	H	COCH ₃ · HCl
15	Cyclopropyl	H	COC ₂ H ₅ · HCl
	Cyclopropyl	H	COC ₂ H ₅
	Cyclopropyl	H	COC ₃ H _{7-n}
	Cyclopropyl	H	COC ₃ H _{7-i}
	Cyclopropyl	H	COC ₄ H _{9-t} · HCl
20	Cyclopropyl	H	COC ₄ H _{9-n}
	Cyclopropyl	H	COC ₆ H _{13-n}

(Fortsetzung)

	R ₁	R ₂	R ₃
	Cyclopropyl	H	COC ₁₁ -H ₂₃ -n
	Cyclopropyl	COCH ₃	COC ₂ H ₅
5	Cyclopropyl	COC ₃ H ₇ -n	COC ₆ H ₁₃ -n
	Cyclopropyl	COCH ₃	COC ₃ H ₇ -n
	Cyclopropyl	COC ₂ H ₅	COC ₃ H ₇ -n
	Cyclopropyl	H	COCyclopropyl
	Cyclopropyl	COCyclopropyl	COCyclopropyl
10	Cyclopropyl	COCH ₃	COCH ₃
	Isopropyl	H	H
	Isopropyl	H	COCH ₃
	Isopropyl	H	COC ₃ H ₇ -n
	Cyclopropyl	H	CONHCH ₃
15	Cyclopropyl	H	CONHC ₃ H ₇ -i
	Cyclopropyl	CONHCH ₃	CONHCH ₃
	Cyclopropyl	H	SCNHCH ₃
	Cyclopropyl	H	CONHCH ₂ CH=CH ₂
	Cyclopropyl	CONHCH ₂ CH=CH ₂	CONHCH ₂ CH=CH ₂
20	Cyclopropyl	CSNHCH ₃	CSNHCH ₃

Besonders hervorgehoben seien die weiteren Wirkstoffe mit den common names Propoxur, Cyfluthrin, Flumethrin, Pyriproxyfen, Methoprene, Diazinon, Amitraz, Fenthion und Levamisol.

In den folgenden Beispielen wird als Wirkstoff 1-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-N-nitro-2-imidazolidinium (common name Imidacloprid) eingesetzt.

Beispiel 1

	Imidacloprid	10 g
	Propylencarbonat	45 g
	Benzylalkohol	45 g
5	®Belsil DMC 6031	1 g
(Ein Polysiloxancopolymerisat der Fa. Wacker GmbH, D-81737 München)		

Beispiel 2

	Imidacloprid	10 g
	n-Octylpyrrolidon-2	44,5 g
10	γ-Butyrolacton	44,5 g
	®Belsil L 066	1 g
(Ein Polysiloxancopolymerisat der Fa. Wacker GmbH, D-81737 München)		

Beispiel 3

	Imidacloprid	8,5 g
15	n-Dodecyl-pyrrolidon	45,25 g
	γ-Butyrolacton	45,25 g
	®Belsil L 066	1 g
(Polysiloxancopolymerisat als Spreitmittel)		

Beispiel 4

20	Imidacloprid	10 g
	Benzylalkohol	89,9 g
	®Belsil DMC 6031	0,1 g
(Polysiloxancopolymerisat als Spreitmittel)		

Beispiel 5

Imidacloprid	12,5 g
Benzylalkohol	70,0 g
Propylencarbonat	17,5 g

5 Beispiel 6

Imidacloprid	10,0 g
1-Cyclohexylpyrrolidon	80,0 g
Propylencarbonat	10,0 g

Beispiel 7

10	Imidacloprid	11,0 g
	Benzylalkohol	70,0 g
	Propylencarbonat	15,0 g
	Isopropylmyristat	4,0 g

Beispiel 8

15	Imidacloprid	12,5 g
	Benzylalkohol	70,0 g
	Propylencarbonat	17,4 g
	Butylhydroxytoluol	0,1 g

Beispiel 9

20	Imidacloprid	10,0 g
	Benzylalkohol	70,0 g
	Propylencarbonat	17,5 g
	Adipinsäure-di-2-ethylhexylester	2,5 g

- 22 -

Beispiel 10

Imidacloprid	12,5 g
Pyrrolidon-2	70,0 g
Propylencarbonat	17,5 g

5 Beispiel 11

Imidacloprid	10,0 g
Pyriproxyfen	1,0 g
Benzylalkohol	70,0 g
Propylencarbonat	18,9 g
10 Butylhydroxytoluol	0,1 g

Beispiel 12

Imidacloprid	12,5 g
Triflumuron	2,5 g
Benzylalkohol	60,0 g
15 Propylencarbonat	27,5 g

Beispiel 13

Imidacloprid	10,0 g
Flumetrin	2,0 g
Benzylalkohol	60,0 g
20 Propylencarbonat	28,0 g

Beispiel 14

	Imidacloprid	10,0 g
	Benzylalkohol	60,0 g
	Ethylencarbonat	15,0 g
5	Propylencarbonat	15,0 g

Anwendungsbeispiel A

2 ml der in Beispiel 1 beschriebenen Formulierung wurde einem 20 kg schweren Hund der mit Flöhen infestiert war auf den Rücken gegossen. Es wurden folgende Ergebnisse erhalten:

5	Zeitraum Tag	Anzahl der Flöhe pro Hund		% Wirkung
		unbehandelt	behandelt	
	-1 Infestation mit 100 Flöhen			
	0 Behandlung und Zählung	30	0	100
	5, 8 Infestation mit 100 Flöhen			
10	9 Zählung	56	0	100
	15 Infestation mit 100 Flöhen			
	16 Zählung	76	0	100
	19 Infestation mit 100 Flöhen (unbehandeltes Tiere)			
15	250 Flöhen (behandelte Tiere)			
	20 Zählung	39	0	100
	26 Infestation mit 100 Flöhen			
	27 Zählung	43	0	100

Anwendungsbeispiel B

5 1 ml der Lösung gemäß Beispiel 4 wurden auf die Schulter eines 20 kg schweren Hundes gegeben. Das Tier wurde nach 2 und nach 6 Tagen der Behandlung mit 200 Flöhen infestiert. Jeweils am Tag 3 und am Tag 7 nach Behandlung wurden die am Hund verbliebenen Flöhe gezählt. Es konnten keine lebenden Flöhe gefunden werden. Die Wirkung war 100 %.

Patentansprüche

1. Mittel zur dermalen Bekämpfung von parasitierenden Insekten an Tieren, gekennzeichnet durch einen Gehalt an
 - 5 - Agonisten oder Antagonisten der nicotinergen Acetylcholinrezeptoren von Insekten in einer Konzentration von 1 bis 20 Gew.-% bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung;
 - Lösungsmittel aus der Gruppe Benzylalkohol oder gegebenenfalls substituierte Pyrrolidone in einer Konzentration von mindestens 20 Gew.-% bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung;
 - 10 - gegebenenfalls weitere Lösungsmittel aus der Gruppe cyclischer Carbonate oder Lactone in einer Konzentration von 5,0 bis zu 80 Gew.-% bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung;
 - gegebenenfalls weitere Hilfsmittel aus der Gruppe Verdickungsmittel, Spreitmittel, Farbstoffe, Antioxidantien, Treibmittel, Konservierungsstoffe, Haftmittel, Emulgatoren, in einer Konzentration
15 von 0,025 bis zu 10 Gew.-% bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung.
2. Verfahren zur Herstellung der Mittel gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man den Wirkstoff mit dem oder den angegebenen
20 Lösungsmitteln vermischt und gegebenenfalls die weiteren Hilfsstoffe zusetzt.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 95/04667

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 6 A01N51/00 A01N61/00 //(A01N51/00,25:02),(A01N61/00,25:02)

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 6 A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO,A,93 24002 (CIBA GEIGY AG ;FRIEDEL THOMAS (AU); MOYSES ERIC WILLIAM (CH); TINE) 9 December 1993 cited in the application see page 1, paragraph 1 see page 9, paragraph 3 - paragraph 4 ---	1,2
Y	EP,A,0 303 490 (MOLECULON INC) 15 February 1989 see column 1, line 3 - column 2, line 21 ---	1,2
Y	US,A,4 415 563 (RAJADHYAKSHA VITHAL J) 15 November 1983 see column 1, line 15 - column 2, line 62 ---	1,2
X	EP,A,0 590 425 (BAYER AG) 6 April 1994 see page 10, line 17 - line 30 ---	1,2
	--- -/--	

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

11 April 1996

Date of mailing of the international search report

13.05.96

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+ 31-70) 340-3016

Authorized officer

Lamers, W

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 95/04667

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP,A,0 483 052 (CIBA GEIGY AG) 29 April 1992 see page 5, line 46 - line 49 see page 6, line 35 see page 10; example F2 see page 15; example B15 ---	1,2
P,X	EP,A,0 682 869 (BAYER AG) 22 November 1995 see page 6, line 46 - line 47 see page 7, line 2 - line 4 ---	1,2
A	GB,A,802 111 (I.I.LUBOWE) 1 October 1958 see page 1, line 9 - line 13 see page 1, line 54 - line 67 ---	1,2
A	EP,A,0 433 909 (CIBA GEIGY AG) 26 June 1991 see page 2, line 1 - line 3 see page 2, line 30 - line 34 see page 4, line 25 - line 28 ---	1,2
A	GB,A,2 194 147 (NISSHIN FLOUR MILLING CO) 2 March 1988 see page 2, line 14 ---	1,2
A	GB,A,2 236 250 (MENTHOLATUM CO LTD) 3 April 1991 see page 3, line 6 - line 12 ---	1,2
A	DE,A,23 31 793 (BAYER AG) 16 January 1975 see page 1, paragraph 1 - paragraph 4 see page 5, line 18 see page 5, line 30 -----	1,2

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 95/04667

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO-A-9324002	09-12-93	CA-A- 2113908 AU-B- 1874692 EP-A- 0616494 JP-T- 6508824 NO-A- 940199 PT-A- 101274 ZA-A- 9303547	09-12-93 30-12-93 28-09-94 06-10-94 20-01-94 31-03-94 23-11-93
EP-A-0303490	15-02-89	US-A- 4804541 AU-B- 618273 AU-B- 2049388 CA-A- 1324757 JP-A- 1066112	14-02-89 19-12-91 16-02-89 30-11-93 13-03-89
US-A-4415563	15-11-83	US-A- 4316893 US-A- 4423040 US-A- 4444762 US-A- 4424210	23-02-82 27-12-83 24-04-84 03-01-84
EP-A-0590425	06-04-94	DE-A- 4232561 CA-A- 2106895 CN-A- 1094218 JP-A- 6192128 NO-A- 933305	31-03-94 30-03-94 02-11-94 12-07-94 30-03-94
EP-A-0483052	29-04-92	AU-B- 652382 AU-B- 8456491 CA-A- 2051480 CN-A- 1059907 JP-A- 4261169 TR-A- 25286 US-A- 5302605	25-08-94 26-03-92 19-03-92 01-04-92 17-09-92 01-01-93 12-04-94
EP-A-0682869	22-11-95	DE-A- 4417742 AU-B- 2014495 CA-A- 2149594 FI-A- 952421 HU-A- 71902 NO-A- 951993 PL-A- 308664	23-11-95 30-11-95 21-11-95 21-11-95 28-02-96 21-11-95 27-11-95

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 95/04667

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
GB-A-802111		NONE	
EP-A-0433909	26-06-91	AU-B- 631259	19-11-92
		AP-A- 195	30-06-92
		AU-B- 6571390	20-06-91
		CA-A- 2032373	19-06-91
		JP-A- 4208220	29-07-92
GB-A-2194147	02-03-88	JP-A- 63051326	04-03-88
		DE-A- 3727585	03-03-88
		KR-B- 9506217	12-06-95
		US-A- 4832954	23-05-89
GB-A-2236250	03-04-91	NONE	
DE-A-2331793	16-01-75	AU-B- 6988474	11-12-75
		BE-A- 816686	23-12-74
		FR-A,B 2233985	17-01-75
		GB-A- 1425810	18-02-76
		JP-C- 1231070	26-09-84
		JP-A- 50035342	04-04-75
		JP-B- 59006844	15-02-84
		LU-A- 70356	27-03-75
		NL-A- 7408296	24-12-74
		US-A- 3980791	14-09-76

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

 International- Aktenzeichen
 PCT/EP 95/04667

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES IPK 6 A01N51/00 A01N61/00 //(A01N51/00,25:02),(A01N61/00,25:02)		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) IPK 6 A01N		
Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	WO,A,93 24002 (CIBA GEIGY AG ;FRIEDEL THOMAS (AU); MOYSES ERIC WILLIAM (CH); TINE) 9.Dezember 1993 in der Anmeldung erwähnt siehe Seite 1, Absatz 1 siehe Seite 9, Absatz 3 - Absatz 4 ---	1,2
Y	EP,A,0 303 490 (MOLECULON INC) 15.Februar 1989 siehe Spalte 1, Zeile 3 - Spalte 2, Zeile 21 ---	1,2
Y	US,A,4 415 563 (RAJADHYAKSHA VITHAL J) 15.November 1983 siehe Spalte 1, Zeile 15 - Spalte 2, Zeile 62 ---	1,2
-/--		
<input checked="" type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen		
<input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie		
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist "E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist "T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden "Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist "Z" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche 11.April 1996		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts 13.05.96
Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2220 HV Rijswijk Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax (+ 31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter Lamers, W

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP 93/04667

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	EP,A,0 590 425 (BAYER AG) 6.April 1994 siehe Seite 10, Zeile 17 - Zeile 30 ---	1,2
X	EP,A,0 483 052 (CIBA GEIGY AG) 29.April 1992 siehe Seite 5, Zeile 46 - Zeile 49 siehe Seite 6, Zeile 35 siehe Seite 10; Beispiel F2 siehe Seite 15; Beispiel B15 ---	1,2
P,X	EP,A,0 682 869 (BAYER AG) 22.November 1995 siehe Seite 6, Zeile 46 - Zeile 47 siehe Seite 7, Zeile 2 - Zeile 4 ---	1,2
A	GB,A,802 111 (I.I.LUBOWE) 1.Oktober 1958 siehe Seite 1, Zeile 9 - Zeile 13 siehe Seite 1, Zeile 54 - Zeile 67 ---	1,2
A	EP,A,0 433 909 (CIBA GEIGY AG) 26.Juni 1991 siehe Seite 2, Zeile 1 - Zeile 3 siehe Seite 2, Zeile 30 - Zeile 34 siehe Seite 4, Zeile 25 - Zeile 28 ---	1,2
A	GB,A,2 194 147 (NISSHIN FLOUR MILLING CO) 2.März 1988 siehe Seite 2, Zeile 14 ---	1,2
A	GB,A,2 236 250 (MENTHOLATUM CO LTD) 3.April 1991 siehe Seite 3, Zeile 6 - Zeile 12 ---	1,2
A	DE,A,23 31 793 (BAYER AG) 16.Januar 1975 siehe Seite 1, Absatz 1 - Absatz 4 siehe Seite 5, Zeile 18 siehe Seite 5, Zeile 30 -----	1,2

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die derselben Patentfamilie gehören

Internationale Aktenzeichen

PCT/EP 95/04667

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO-A-9324002	09-12-93	CA-A- 2113908	09-12-93
		AU-B- 1874692	30-12-93
		EP-A- 0616494	28-09-94
		JP-T- 6508824	06-10-94
		NO-A- 940199	20-01-94
		PT-A- 101274	31-03-94
		ZA-A- 9303547	23-11-93
EP-A-0303490	15-02-89	US-A- 4804541	14-02-89
		AU-B- 618273	19-12-91
		AU-B- 2049388	16-02-89
		CA-A- 1324757	30-11-93
		JP-A- 1066112	13-03-89
US-A-4415563	15-11-83	US-A- 4316893	23-02-82
		US-A- 4423040	27-12-83
		US-A- 4444762	24-04-84
		US-A- 4424210	03-01-84
EP-A-0590425	06-04-94	DE-A- 4232561	31-03-94
		CA-A- 2106895	30-03-94
		CN-A- 1094218	02-11-94
		JP-A- 6192128	12-07-94
		NO-A- 933305	30-03-94
EP-A-0483052	29-04-92	AU-B- 652382	25-08-94
		AU-B- 8456491	26-03-92
		CA-A- 2051480	19-03-92
		CN-A- 1059907	01-04-92
		JP-A- 4261169	17-09-92
		TR-A- 25286	01-01-93
		US-A- 5302605	12-04-94
EP-A-0682869	22-11-95	DE-A- 4417742	23-11-95
		AU-B- 2014495	30-11-95
		CA-A- 2149594	21-11-95
		FI-A- 952421	21-11-95
		HU-A- 71902	28-02-96
		NO-A- 951993	21-11-95
		PL-A- 308664	27-11-95

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die derselben Patentfamilie gehören

Internationale Aktenzeichen

PCT/EP 95/04667

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
GB-A-802111		KEINE	
EP-A-0433909	26-06-91	AU-B- 631259	19-11-92
		AP-A- 195	30-06-92
		AU-B- 6571390	20-06-91
		CA-A- 2032373	19-06-91
		JP-A- 4208220	29-07-92
GB-A-2194147	02-03-88	JP-A- 63051326	04-03-88
		DE-A- 3727585	03-03-88
		KR-B- 9506217	12-06-95
		US-A- 4832954	23-05-89
GB-A-2236250	03-04-91	KEINE	
DE-A-2331793	16-01-75	AU-B- 6988474	11-12-75
		BE-A- 816686	23-12-74
		FR-A,B 2233985	17-01-75
		GB-A- 1425810	18-02-76
		JP-C- 1231070	26-09-84
		JP-A- 50035342	04-04-75
		JP-B- 59006844	15-02-84
		LU-A- 70356	27-03-75
		NL-A- 7408296	24-12-74
		US-A- 3980791	14-09-76